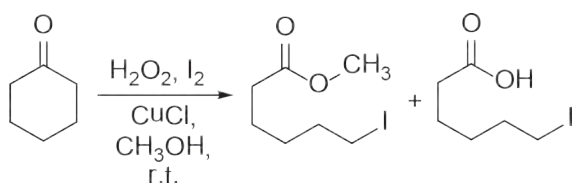
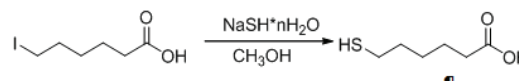


**Схема 1.** Структура ДМСК и  $^{99m}\text{Tc(III)}$  – ДМСК



**Схема 2.** Получение метилового эфира  $\omega$ -иодгексановой кислоты и  $\omega$ -иодгексановой кислоты



**Схема 3.** Получение 6-тиогексановой кислоты

гидросульфид. Подобранные условия позволили значительно снизить содержание побочного продукта – тиоэфира до 10%.

Следующей etapом было получение 6-тиогексановой кислоты. Для этой цели был использован метил 6-тиогексаноат. Гидролиз проводили в смеси ацетонитрил-вода. В данном случае происходит окисление эфира с образованием побочного продукта (дисульфида 40%).

Поэтому для получения 6-тиогексановой кислоты целесообразнее использовать 6-иодгексановую кислоту, действуя на нее натрия гидросульфидом (схема 3).

Таким образом, по данным  $^1\text{H}$ -ЯМР-спектра в таких условиях образование побочного продукта – тиоэфира уменьшается (до 5%).

## Список литературы

1. M.S. Ardestani, Novel and facile methods for the synthesis of DTPA-mono-amide: a new completely revised strategy in radiopharmaceutical chemistry // *J Radioanal Nucl Chem.*, 2010. – Vol.283. – P.447–455.
2. W. Kieviet, Technetium Radiopharmaceuticals: Chemical Characterization and Tissue Distribution of Tc-Glucoheptonate Using Tc-99m and Carrier Tc-99 // *J Nucl Med.*, 1981. – Vol.22. – P.703–709.
3. Пат. 2404812 РФ, МПК8: C07C55/00 Способ получения  $\omega$ -иодалифатических карбоновых кислот и их эфиров / Юсубов М.С., Жданкин В.В., Ларькина М.С., Дрыгунова Л.А. – № 2012136163/04. – заявл. 21.08.2012. – опубл. 27.09.2013. – Бюл. №27.

## ПОЛУЧЕНИЕ N-КАРБАМОИЛ-N'-БЕНЗГИДРИЛАМИНОКИСЛОТ

Е.А. Поспелова, В.Ю. Куксенюк

Научный руководитель – к.х.н., доцент В.В. Штрыкова

Национальный исследовательский Томский политехнический университет  
634050, Россия, г. Томск, пр. Ленина 30, e.a.pospelova@mail.ru

Известно, что бензгидрилмочевины (БГМ) обладают выраженной противосудорожной активностью [1]. Наибольшую активность в ряду БГМ проявляет м-хлорБГМ (оригинальный препарат галодиф).

Одним из направлений по созданию новых лекарственных препаратов является создание структур, содержащих в своём составе фрагменты уже известных лекарственных средств. Наиболее интересными производными БГМ могут быть N-карбамоил-N'-бензгидриламинокислоты, содержащие в структуре остатки природных

$\alpha$ -аминокислот. Аминокислоты, как известно, обладают различной биологической активностью, адаптированы к человеческому организму и, кроме того, являются оптически активными соединениями. Поэтому включение их в структуру препарата может усилить его терапевтический эффект.

Нами была разработана схема синтеза N'-алкилированных производных N-карбамоиламинокислот (1-6), заключающаяся в получении соединений (1-6) реакцией взаимодействия соответствующих аминокислот с  $\text{NaNCO}$  и их

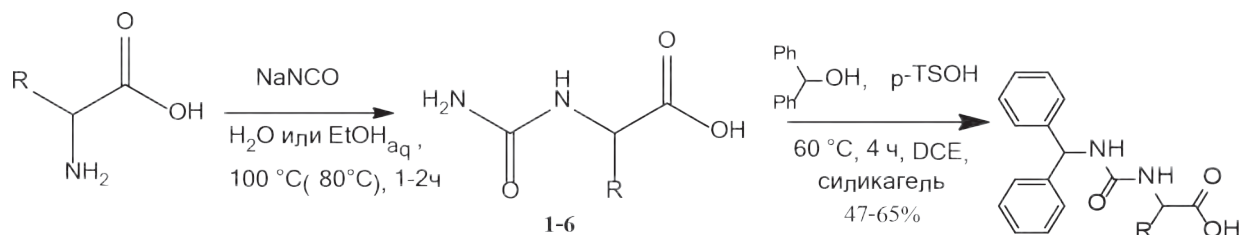


Схема 1.

последующим алкилированием бензгидролом в среде пара-толуолсульфокислоты и силикагеля, в качестве водоотнимающего агента. (схема 1).

Получение карбамоиламинокислот 1-3 происходило по известной методике [2], для получения соединений 4-6, обладающих высокой растворимостью в воде, была проведена замена растворителя на этанол (таблица 1).

Контроль за ходом реакции проводился методом ВЭЖХ. Структура полученных N-карбамоил-N'-бензгидриламинокислот была доказана методом ЯМР  $^1\text{H}$  спектроскопии.

Таким образом, разработанным нами методом были впервые получены N-карбамо-

Таблица 1. Получение N-карбамоиламинокислот

Продукт	R	Растворитель	Время, ч.	Выход, %
1	H	$\text{H}_2\text{O}$	1	94
2	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$		1	87
3	$\text{CH}_2\text{SH}$		1	67
4	$\text{CH}_3$	$\text{EtOH}_{\text{aq}}$	2	80
5	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{COOH}$		2	73
6	$\text{CH}_2-(p\text{-OH-Ph})$		2	84

ил-N'-бензгидриламинокислоты. Найденный способ позволит получить N-карбамоил-производные противосудорожного препарата галодиф.

Работа выполнена при финансовой поддержке Гос. задания «Наука», проект № 2387.

### Список литературы

1. Шушпанова Т.В., Новожеева Т.П., Семке В.Я. // Сборник Человек и лекарство, 2011.– 363с.
2. A.N. Kravchenko, E.Yu. Maksareva, P.A.

Belyakov // Russian Chemical Bulletin, International Edition, 2003.– Vol.52.– №1.– P.192–197.

## СИНТЕЗ ИОДПИРИДИНОВ ИЗ ПИРИДИЛТРИФЛАТОВ ПОД ДЕЙСТВИЕМ ЙОДИСТОВОДОРОДНОЙ КИСЛОТЫ

М.И. Потапова, А.Н. Санжиев, А.Ж. Касанова

Научный руководитель – д.х.н., профессор Е.А. Краснокутская

Национальный исследовательский Томский политехнический университет  
634050, Россия, г. Томск, пр. Ленина 30, marinapotapova1994@mail.ru

Иодпиридины всегда привлекали к себе значительный интерес. Они являются важными строительными блоками и структурными фрагментами для синтеза биологически активных веществ, мономеров для современных полимерных материалов, лигандов для металлокомплексного катализа.

Однако методы синтеза иодпиридинов весьма ограничены и представляют собой диазотирование аминопиридинов [1–2], нуклеофильное замещение хлорпиридинов [3], а также получа-

емых *in situ* пиридилтрифлатов [4]. Данные методы, как правило, не обеспечивают хороших выходов целевых иодпиридинов.

На кафедре Биотехнологии и органической химии Национального исследовательского Томского политехнического университета был разработан удобный метод получения широкого

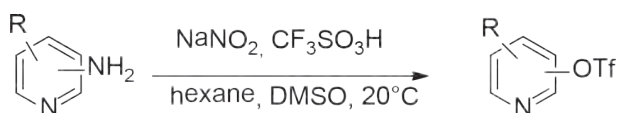


Схема 1.